

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平6-80544

(43)公開日 平成6年(1994)3月22日

(51)Int.Cl.⁶ 識別記号 庁内整理番号 F I 技術表示箇所
A 61 K 7/16 7252-4C
47/02 J 7433-4C

審査請求 有 請求項の数 9(全 6 頁)

(21)出願番号 特願平5-42386

(22)出願日 平成5年(1993)3月3日

(31)優先権主張番号 846315

(32)優先日 1992年3月5日

(33)優先権主張国 米国(US)

(71)出願人 590003065

ユニリーバー・ナームローゼ・ベンノート
シャープ

オランダ国ロッテルダム、ヴェーナ 455

(72)発明者 デビッド・ロバート・ウイリアムス

アメリカ合衆国、コネチカット・06468、

モンロー、クラウン・ビュー・ドライブ・

77

(72)発明者 クリストイーン・ワトソン・ライレス

アメリカ合衆国、コネチカット・06460、

カウンティ・オブ・ニュー・ヘブン、ミル

フォード・ウェンディ・ロード・96

(74)代理人 弁理士 川口 義雄 (外2名)

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 フッ化物を含む安定化過酸化物ゲル

(57)【要約】

【構成】 過酸素化合物(例えば過酸化水素)と、フッ化物含有抗う食剤と、スズ化合物(特に塩化第一スズ)とを含んでいる口腔用組成物を提供する。

【効果】 スズ化合物は、通常フッ化物の存在によって引き起こされる分解から過酸素化合物を安定させる。

ルが過酸化物組成物の他の好ましい成分である。グリセロールの量は、約5～約50重量%であり、リンスの場合には好ましくは約5～約20重量%であり得るが、ゲルの場合には約35～約45重量%が好ましい。

【0026】微量の添加成分が本発明の組成物に存在してもよい。少量の着色料、着香料及び酸化防止剤が含まれてもよい。

【0027】本発明の口内用組成物は、過酸化物組成物の他に、別個の重炭酸塩含有組成物を含んでいてもよく、これらはそれぞれ、口内で使用するために実質的に同量を同時に供給する別々の容器に入れられている。

【0028】重炭酸塩組成物も、過酸化物組成物のところで説明したフッ化物含有化合物の中から選択した抗う食性フッ化物含有化合物をほぼ同量含んでいる。フッ化ナトリウムが特に好ましい。重炭酸塩は、アルカリ金属（例えばナトリウム及びカリウム）の塩の形態で存在する。通常、重炭酸塩の濃度は、組み合わせた歯科用製品全体の約0.5～約80重量%、好ましくは約5～約50重量%、最適には約8～約20重量%である。重炭酸塩組成物のpHは約7.0～約9.5、最も好ましくは約8.0～9.0であり得る。重炭酸塩組成物が練り歯磨き又はゲル状のときには通常、天然又は合成の増粘剤が約0.1～10重量%、好ましくは約0.5～5重量%含まれる。増粘剤としてはヒドロキシプロビルメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ナトリウムカルボキシメチルセルロース、キサンタンゴム、トラガカントゴム、カラヤゴム、アラビアゴム、トチャガ、デンブン、アルギネット及びカラゲナンが含まれ得る。

【0029】重炭酸塩組成物には通常界面活性剤も含まれる。これらの界面活性剤はアニオン、非イオン、カチオン又は両性型であり得る。ラウリル硫酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム及びラウリルサルコシン酸ナトリウムが最も好ましい。界面活性剤は通常、約0.5～約5重量%の量で存在する。

【0030】練り歯磨き又はゲル状のときには、重炭酸塩組成物は通常、重炭酸塩の他に、研磨剤を含んでいる。研磨剤は、メタリン酸塩の水不溶性アルカリ又はアルカリ土類金属塩（IMP）、炭酸カルシウム、アルミニン酸カルシウム及びケイ酸カルシウムの中から選択し得る。シリカ、リン酸二カルシウム及び炭酸カルシウムが*40

*特に好ましい。研磨剤の量は約5～約80重量%である。

【0031】歯石抑制剤を本発明の組成物に加えてもよい。リンを含む抑制剤が特に効果的である。無機リンの歯石抑制剤には、トリポリリン酸ナトリウム又は任意の水溶性ピロリン酸塩（例えばピロリン酸二ナトリウム、ピロリン酸二カリウム及びこれらとピロリン酸四カリウム又はピロリン酸四ナトリウムとの混合物）が含まれ得る。歯石抑制剤として機能し得る有機リン化合物には、ポリホスホン酸塩（例えばエタン-1-ヒドロキシ-1,1-ジホスホン酸二ナトリウム（EDDP）、メタジホスホン酸、及び2-ホスホノブタン-1,2,4-トリカルボン酸）が含まれる。

【0032】着香料は通常、過酸化物組成物及び（適していれば）重炭酸塩組成物の両方に存在する。これらの着香料はミドリハッカ油及びハッカ油を主成分とし得る。他の着香料材料の例としては、メントール、クローブ、ヒメコウジ、ユーカリ及びアニスの実が含まれる。着香料は組成物全体の約0.1～約5重量%の濃度であり得る。

【0033】甘味料（例えばサッカリン、シクラミン酸ナトリウム、アスパルテーム、スクロース等）が組成物全体の約0.1～約5重量%の量で含まれ得る。

【0034】他の添加剤〔例えば保存料、シリコーン、他の合成又は天然のポリマー（Gantrez S-97（登録商標））及び抗歯肉炎活性剤〕が更に、口内用組成物に含まれてもよい。

【0035】

【実施例】以下の実施例で本発明の実施態様を更に詳しく説明する。本明細書及び前述の特許請求の範囲に記載する全ての部、パーセンテージ及び比率は、特に明記しない限り組成物全体の重量比である。

【0036】実施例1

本発明の典型例は過酸化物ゲル組成物であって、その配合を表Iで詳しく説明する。表Iの配合物を、表IIで詳しく説明する重炭酸塩組成物と組み合わせて使用してもよい。各組成物は二区画型ディスペンサーの別々の区画に入っている。

【0037】

【表I】

表I
過酸化物ゲル成分

成分	重量%
Pluronic F127	20.000
グリセリン	40.000
過酸化水素（3.5%食品用鉱柄）	4.285
サリチル酸メチル	0.500
フッ化ナトリウム	0.230
塩化第一スズ	0.230
F D & C ブルー1	0.005

7

リン酸 (8.5%w/w)
脱イオン水

8

0.150
残り

【0038】

**【表2】

表II

重炭酸塩ベースト成分

成分	重量%
Polyol II (ソルビトール及び他の糖)	48.710
Syloid 63XX (研磨用シリカ)	15.000
重炭酸ナトリウム	10.000
PEG 32 (ポリエチレンジリコール)	5.000
Sylox 15x (増粘用シリカ)	4.600
ラウリル硫酸ナトリウム	2.980
SD Alcohol 38B	2.850
セルロースゴム	0.800
メントール	0.500
サッカリンナトリウム	0.500
フッ化ナトリウム	0.230
二酸化チタン	0.300
脱イオン水	残り

実施例2

過酸化物ゲル組成物に対する塩化第一スズ及びその濃度の作用を評価するために、一連の安定度実験を実施した。

【0039】使用した試験は過酸化物の安定度／応力試験(P SST)であった。試料を95°Cの温度で6時間促進老化させた。これらの老化条件は、105°Fでの3ヵ月の貯蔵安定度試験と良好な相関関係を有することが判明した。ヨウ化カリウムをヨウ素に酸化し、レドックス電極を備えた自動滴定器上においてチオ硫酸ナトリウムで滴定して、ゲルの過酸化物含量を検定した。

【0040】6時間の加熱時間後の残留過酸化物を定量する他に、長期安定性の指標としてゲルの色も記録した。

【0041】実施例1の表Iに記載の成分と同一の成分を有する(但しフッ化物及び第一スズ成分は異なる)ゲル組成物を評価した。表IIIはこれらの試験の結果を示している。

【0042】

【表3】

表III

過酸化物の安定度の結果

フッ化物含有化合物	スズ化合物	過酸化物の回収%
モノフルオロリン酸ナトリウム	なし	0.0
フッ化ナトリウム	なし	0.0
なし	なし	81.3
なし	塩化第一スズ	47.5
フッ化ナトリウム	塩化第一スズ	96.0

塩化第一スズによって、フッ化ナトリウム含有ゲル組成物が、P SST評価の苛酷な条件下でも殆ど全ての過酸化水素成分を不变の状態に維持し得ることが、表III 40から明白である。実際に、フッ化ナトリウムと塩化第一スズとを含むゲルは、これら2種の成分のいずれも含ま★

★ない対照ゲルよりも安定している。塩化第一スズ自体は安定化には作用せず、実際には過酸化物ゲル組成物を不安定にしている。

【0043】

【表4】

表IV

塩化第一スズの濃度(%)	過酸化水素の回収%
0	0
0.035	9.5
0.07	30.3
0.14	96.1
0.27	98.7
0.54	96.3

9

1. 08

2. 16

64. 6

6. 2

10

フッ化ナトリウムの量が一定の場合、塩化第一スズが過酸化水素含有ゲル組成物（表Ⅰの配合物）の0. 1～1. 0重量%の量で最適な効果を有することを表Ⅳの結果は示している。

【0044】実施例3

本実施例は、塩化第一スズ及びフッ化物の量が一定の場*

* 合における過酸化物ゲルの安定度に対するpHの作用を示す。表Ⅰに示す過酸化物組成物をこれらの試験で使用した。存在するリン酸の量を操作して、酸性度を変えた。

【0045】

【表5】

表V

過酸化物ゲルの安定度に対するpHの作用（スズは存在）

<u>pH</u>	<u>過酸化水素の回収%</u>
2. 0	89
2. 5	97
3. 0	98
3. 5	100

フッ化物の濃度を1150 ppmと一定にし、また塩化第一スズの二水和物の全濃度を0. 27%として、試験を実施した。P SST評価に基づけば、pHが2. 0から3. 5まで上昇すると、安定度が改善された。これは、第一スズ塩を含んでいない過酸化物ゲルのP SST ≈ 20

表VI

過酸化物ゲルの安定度に対するpHの作用（スズは不在）

<u>pH</u>	<u>過酸化水素の回収%</u>
2. 0	97
2. 5	94
3. 0	90
3. 5	46
4. 4	0

これまでの説明及び実施例は、本発明の選択した具体例を示している。従って、本発明の範囲を逸脱することな★30

★く、当業者に種々の変形が提案されるであろう。

フロントページの続き

(72)発明者 アリグザーンダー・ジョージ・ジムキウ
イツクズ
アメリカ合衆国、コネチカット・06484、
シエルトン、ブルース・ドライブ・39